

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 5 月 6 日 (06.05.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/040093 A1(51) 国際特許分類: C07C 233/43, 311/08, C07D 235/24,
A61K 31/18, 31/192, 31/216, 31/235, 31/4184, 31/36,
A61P 1/14, 1/16, 3/04, 3/06, 3/10, 13/02, 25/24, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/015005

(22) 国際出願日: 2004 年 10 月 5 日 (05.10.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2003-364685
2003 年 10 月 24 日 (24.10.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): キッセイ薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒399-8710 長野県 松本市 芳野 1 9 番 4 8 号 Nagano (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小林 淳一 (KOBAYASHI, Junichi) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南 安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 中村 哲也 (NAKAMURA, Tetsuya) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南 安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 村仲

秀幸 (MURANAKA, Hideyuki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南 安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 石川 健宏 (ISHIKAWA, Takehiro) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南 安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 玉井 哲郎 (TAMAI, Tetsuro) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南 安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 赤羽 敏 (AKAHANE, Satoshi) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南 安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP).

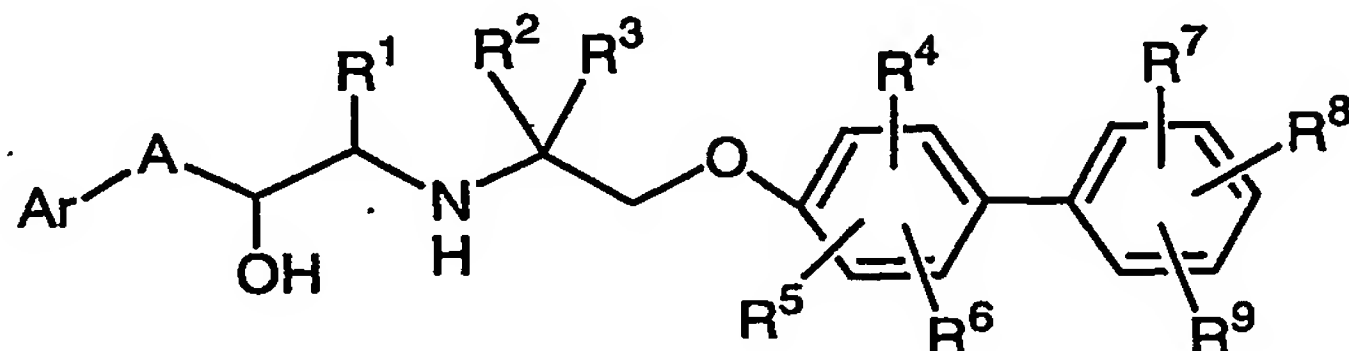
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,

[続葉有])

(54) Title: AMINO ALCOHOL DERIVATIVE, MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THE SAME, AND USE OF THESE

(54) 発明の名称: アミノアルコール誘導体、それを含有する医薬組成物およびそれらの用途



(I)

(57) Abstract: A compound having potent irritative activity against a human β_3 -adrenergic receptor and high selectivity therefor and represented by the general formula (I) (wherein R^1 is hydrogen or lower alkyl; R^2 and R^3 each independently is hydrogen or lower alkyl; R^4 , R^5 , and R^6 each independently is hydrogen, halogeno, lower alkyl, or lower alkoxy; R^7 is hydrogen or lower alkyl; R^8 is hydrogen, halogeno, lower alkyl, lower alkoxy, etc.; R^9 is $-\text{COR}^{10}$, $-\text{A}^1-\text{COR}^{10}$, $-\text{O}-\text{A}^2-\text{COR}^{10}$, etc.; Ar is optionally substituted phenyl or heteroaryl; and A is a bond, $-\text{OCH}_2$, etc.), a prodrug of the compound, or a pharmacologically acceptable salt of either.(57) 要約: ヒト β_3 -アドレナリン受容体に対して強力な刺激作用と高い選択性を有する一般式(I) [式中、 R^1 は水素または低級アルキルであり; R^2 および R^3 は、それぞれ独立して水素または低級アルキルであり; R^4 、 R^5 および R^6 は、それぞれ独立して水素、ハロゲン、低級アルキルまたは低級アルコキシであり; R^7 は水素または低級アルキルであり; R^8 は水素、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシなどであり; R^9 は $-\text{COR}^{10}$ 、 $-\text{A}^1-\text{COR}^{10}$ または $-\text{O}-\text{A}^2-\text{COR}^{10}$ などであり;Arは置換されてもよいフェニル基、またはヘテロアリアル基を表し;Aは結合、 $-\text{OCH}_2$ などである]で表される化合物、そのプロドラッグ、またはその薬理学的に許容される塩;それを含有する医薬組成物およびそれらの用途を提供する。

WO 2005/040093 A1



KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書